

WO9961029A1: SLEEP INDUCING AGENT

[View Images \(24 pages\)](#) | [View Cart](#)

Premium Data ¹: [PDF \(2286 KB\)](#) | [TIFF \(1800 KB\)](#) | [Fax](#) | [More choices...](#)

Inventor(s): **TANAMI, Tohru** , Taisho Pharmaceutical Co., Ltd., 24-1, Takata 3-chome, Toshima-ku, Tokyo 170.ndash, Japan
KAMEO, Kazuya , Taisho Pharmaceutical Co., Ltd., 24-1, Takata 3-chome, Toshima-ku, Tokyo 170.ndash, Japan
YAMADA, Kenji . Taisho Pharmaceutical Co., Ltd., 24-1, Takata 3-chome, Toshima-ku, Tokyo 170.ndash, Japan
OKUYAMA, Shigeru , Taisho Pharmaceutical Co., Ltd., 24-1, Takata 3-chome, Toshima-ku, Tokyo 170.ndash, Japan
ONO, Naoya , Taisho Pharmaceutical Co., Ltd., 24-1, Takata 3-chome, Toshima-ku, Tokyo 170.ndash, Japan

Applicant(s): **SATO, Fumie**. 2-1-901, Kugenumahigashi, Fujisawa-shi, Kanagawa 251-0026, Japan


Issued/Filed Dates: **Dec. 2, 1999** / May 25, 1999

Application Number: **WO1999JP0002723**

IPC Class: **A61K 031/557; C07C 405/00**

Designated Countries: AU. CA. CN. JP. KR. US. **European patent:** AT. BE. CH. CY. DE. DK. ES. FI. FR. GB. GR. IE. IT. LU. MC. NL. PT. SE

Abstract: A sleep inducing agent comprising, as an active component, a prostaglandin derivative represented by formula (1), wherein X represents a halogen atom, Y represents a group represented by (CH2)m, a cis-vinylene group or a phenylene group, Z represents an ethylene group, a trans-vinylene group, OCH2 or S(O)nCH2, R1 is a C3-10 cycloalkyl group, a C3-10 cycloalkyl group substituted with a C1-4 alkyl group, a C4-13 cycloalkylalkyl group, a C5-10 alkyl group, a C5-10 alkenyl group, an C5-10 alkynyl group or a bridged cyclic hydrocarbon group, R2 represents a hydrogen atom, a C1-10 alkyl group or a C3-10 cycloalkyl, m is an integer of 1 to 3, and n is 0, 1 or 2, or a pharmaceutically acceptable salt or hydrate thereof.
[\[Show "fr" Abstract\]](#)

Representative image: 
[\[Show "fr" image\]](#)

Attorney, Agent, or Firm: **KITAGAWA, Tomizo**
Foreign References: **none**


(No patents reference this one)



Alternate Searches

 [Patent Number](#)  [Boolean Text](#)  [Advanced Text](#)

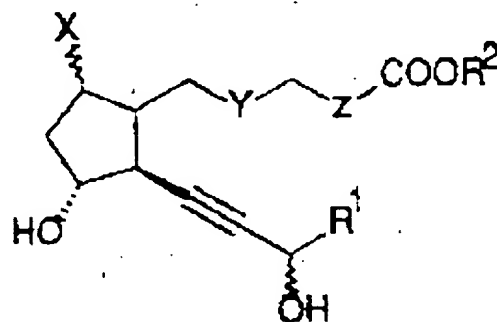
Nominate this invention

Patent  [SEARCH PATENT FILE TEXT](#)

BEST AVAILABLE COPY

(57)要約

式



(式中、Xはハロゲン原子を示し、Yは $(CH_2)_m$ で表シスビニレン基又はフェニレン基を示し、Zはエチレン、スビニレン基、 OCH_2 又は $S(O)_2CH_2$ を示し、 R^1 シクロアルキル基、 C_{1-10} のアルキル基で置換された C_{1-10} アルキル基、 C_{1-10} のシクロアルキルアルキル基、 C_{1-10} アル基、 C_{5-10} のアルケニル基、 C_{5-10} のアルキニル基又炭化水素基を示し、 R^2 は水素原子、 C_{1-10} のアルキル基のシクロアルキル基を示し、mは1～8の整数を示し、又は2を示す。)

で表されるプロスタグランジン誘導体又はその薬理学的な塩および水和物を有効成分とする睡眠誘発剤。

PCTに基づいて公開される国際出願のパンフレット第一頁に掲載されたPCT加盟国を同定するために使

AE アラブ首長国連邦
AL アルバニア
AM アルメニア
AT オーストリア
AU オーストラリア

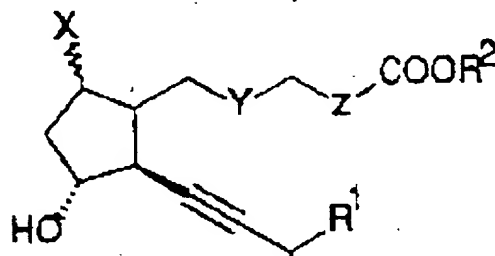
DM ドミニカ
EE エストニア
ES スペイン
FI フィンランド
FR フランス

KZ カザフスタン
LC セントルシア
LI リヒテンシュタイン
LK スリランカ
LR リベリア

RU
SI
SI
SC
S

(57)要約

式



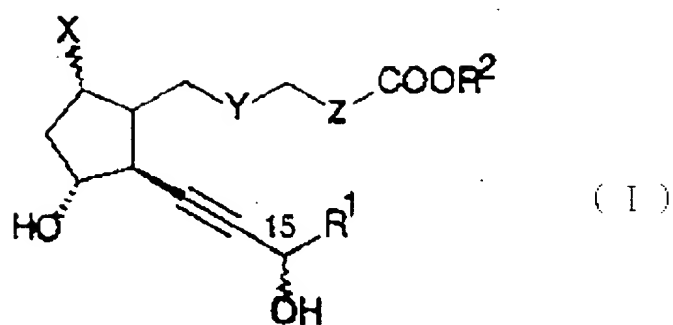


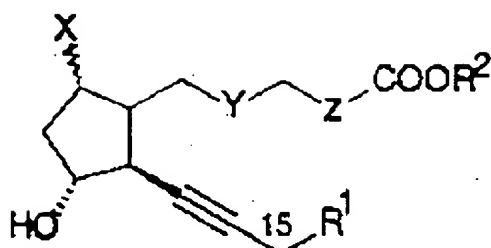
表 1

	X	Y	Z	R ¹	R ²
化合物 1	β -Cl	CH=CH	OCH ₂	シクロヘキシル	tert-7'チル
化合物 2	β -Cl	CH=CH	OCH ₂	シクロヘキシル	メチル
化合物 3	β -Cl	CH=CH	OCH ₂	シクロヘキシル	メチル
化合物 4	β -Cl	CH=CH	OCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物 5	β -Cl	CH=CH	OCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物 6	α -Cl	CH=CH	OCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物 7	β -Br	CH=CH	OCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物 8	β -Br	CH=CH	OCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物 9	F	CH=CH	OCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物 10	β -Br	CH=CH	OCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物 11	β -Br	CH=CH	OCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物 12	β -Br	CH=CH	OCH ₂	シクロヘキシルメチル	水素
化合物 13	β -Br	CH=CH	OCH ₂	シクロヘキシルメチル	水素
化合物 14	β -Cl	CH=CH	SCH ₂	シクロヘキシル	tert-7'チル
化合物 15	β -Cl	CH=CH	SCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物 16	β -Cl	CH=CH	OCH ₂	シクロヘキシル	tert-7'チル

WO 99/61029

PC

6



(I)



世界知的所有権機関

国際事務局

PCT

特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(51) 国際特許分類6 A61K 31/557, C07C 405/00	A1	(11) 国際公開番号 (43) 国際公開日 1999年5月25日(25.05.99)
(21) 国際出願番号 PCT/JP99/02723	(72) 発明者；および (75) 発明者／出願人（米国についての 田名 晃亨(TANAMI, Tokuo)[JP/JP] 亀尾 一弥(KAMEO, Kazuya)[JP/JP] 山田 盛司(YAMADA, Koji)[JP/JP] 奥山 茂(OKUYAMA, Shigeru)[JP/JP] 小野直哉(ONO, Naoya)[JP/JP] 〒170-8633 東京都豊島区高田3丁目24番 大正製薬株式会社内 Tokyo, (JP)	(74) 代理人 弁理士 北川 富造(KITAGAWA, Tomizo) 〒170-8633 東京都豊島区高田3丁目24番 大正製薬株式会社 特許部 Tokyo, (JP)
(22) 国際出願日 1999年5月25日(25.05.99)	(71) 出願人（米国を除くすべての指定国について） 大正製薬株式会社 (TAISHO PHARMACEUTICAL CO., LTD.)(JP/JP) 〒170-8633 東京都豊島区高田3丁目24番1号 Tokyo, (JP)	(81) 指定国 AU, CA, CN, JP, KR, US, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE,
(30) 優先権データ 特願平10/142622 1998年5月25日(25.05.98) JP	(71) 出願人；および (72) 発明者 佐藤史尚(SATO, Fumio)[JP/JP] 〒251-0026 神奈川県藤沢市鵠沼東2-1-901 Kanagawa, (JP)	添付公開書類 国際調査報告書

(54)Title: SLEEP INDUCING AGENT

(54)発明の名称 睡眠誘発剤

(57) Abstract

A sleep inducing agent comprising, as an active component, a prostaglandin derivative represented by formula (1), wherein X represents a halogen atom, Y represents a group represented by $(CH_2)_m$, a cis-vinylene group or a phenylene group, Z represents an ethylene group, a trans-vinylene group, OCH_2 or $Si(O)_nCH_2$, R^1 is a C_{2-10} cycloalkyl group, a C_{3-10} cycloalkyl group substituted with a C_{1-3} alkyl group, a C_{3-10} cycloalkylalkyl group, a C_{2-10} alkyl group, a C_{2-10}

スコア	0: 0 - 50 秒A
SCORE	1: 60 - 225 秒A
	2: 225 - 450 秒A
	3: 450 - 675 秒A
	4: 675 - 800 秒A

B —○— 初回投与時
C —●— 投与後 3: 1 μg/monkey, i.e.
C —▲— 投与後 3: 10 μg/monkey, i.e.

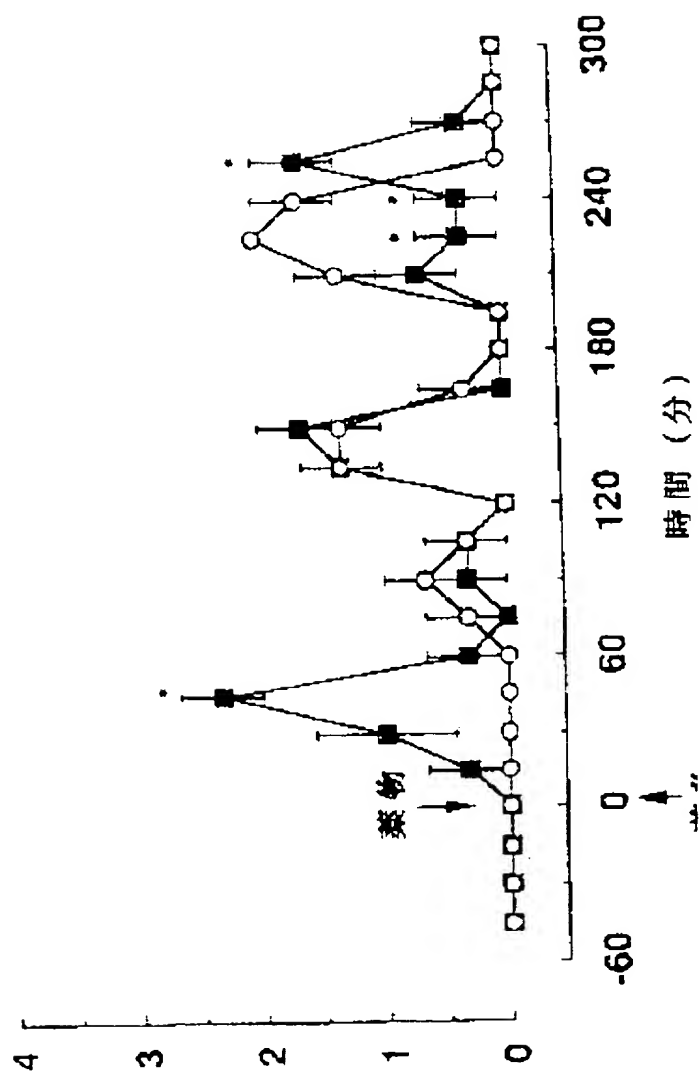
* : p < 0.05



2 / 2

実験7-	0:	0 - 60 秒
	1:	60 - 225 秒
	2:	225 - 450 秒
	3:	450 - 675 秒
	4:	675 - 900 秒

—○— 溶媒投与群
 —■— PG D₂ 10 μg/monkey, i.c.
 * : p < 0.05 (対 溶媒投与群)



1 / 2

スコア 0: 0 - 60 秒
1: 60 - 225 秒
2: 225 - 450 秒
3: 450 - 675 秒
4: 675 - 900 秒

* : $p < 0.05$ (対 溶媒投与群)

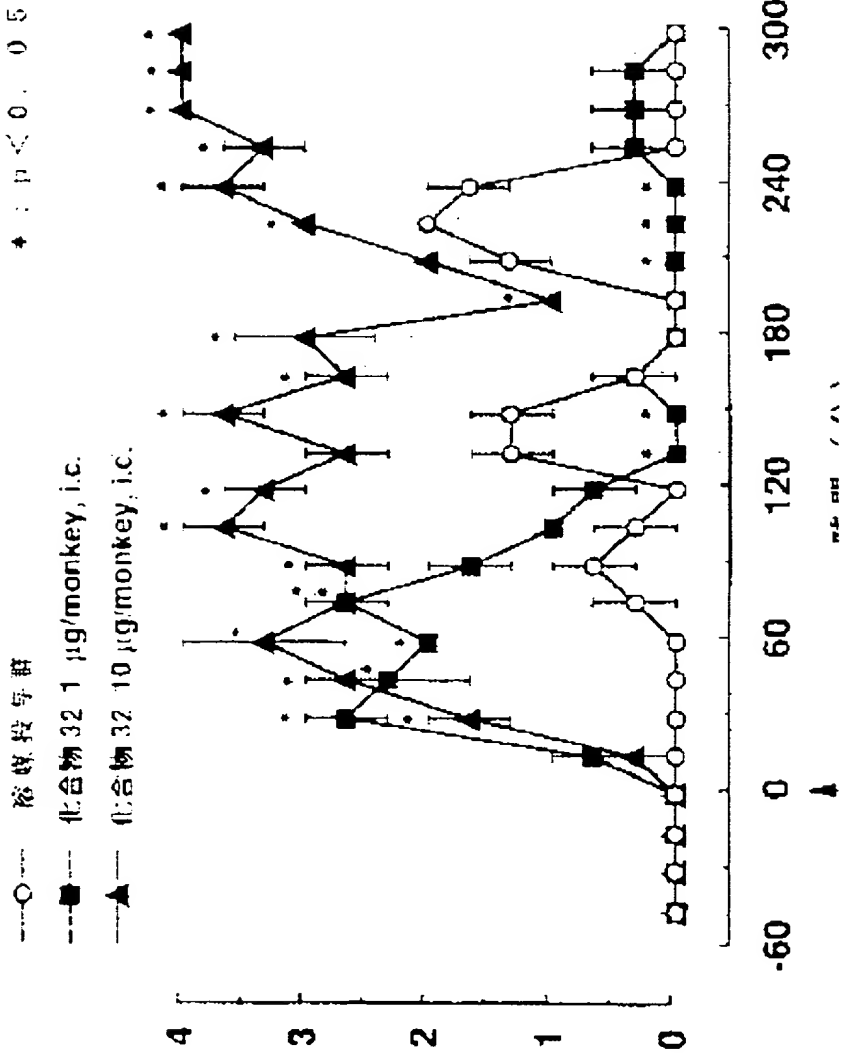


表 1 のつづき

	X ¹	Y	Z	R ¹	R ²
化合物 71	β -Cl	CH ₂ CH ₂	CH=CH	シクロヘキシル	水素
化合物 72	β -Cl	CH ₂ CH ₂ CH ₂	CH=CH	シクロヘキシル	水素
化合物 73	β -Cl	CH ₂ CH ₂	CH=CH	シクロヘキシル	メチル
化合物 74	β -Cl	CH ₂ CH ₂	CH=CH	シクロヘキシル	水素
化合物 75	β -Cl	CH ₂ CH ₂	CH=CH	シクロヘキシル	メチル
化合物 76	β -Cl	CH ₂ CH ₂	CH=CH	シクロヘキシル	水素
化合物 77	β -Cl	CH ₂ CH ₂	CH=CH	シクロヘキシルメチル	メチル
化合物 78	β -Cl	CH ₂ CH ₂	CH=CH	シクロヘキシルメチル	水素
化合物 79	β -Cl	CH ₂ CH ₂	CH=CH	シクロヘキシルメチル	メチル
化合物 80	β -Cl	CH ₂ CH ₂	CH=CH	シクロヘキシルメチル	水素
化合物 81	β -Cl	CH ₂ CH ₂	CH=CH	2-メチル-1-ヘキシル	メチル
化合物 82	β -Cl	CH ₂ CH ₂	CH=CH	2-メチル-1-ヘキシル	水素
化合物 83	β -Cl	CH ₂ CH ₂	CH=CH	2,6-ジメチル-5-ヘプテニル	メチル
化合物 84	β -Cl	CH ₂ CH ₂	CH=CH	2,6-ジメチル-5-ヘプテニル	水素
化合物 85	β -Cl	CH ₂ CH ₂	CH=CH	1-メチル-3-ヘキシル	メチル
化合物 86	β -Cl	CH ₂ CH ₂	CH=CH	1-メチル-3-ヘキシル	水素

本発明に係る化合物は、経口的に、または静脈内もしくは
 与などの非経口的に投与することができる。これらは、例
 常の方法により製造することができる錠剤、粉剤、顆粒剤
 セブセル剤、液剤、乳剤、懸濁剤等の形で経口投与するこ

表 1 のつづき

	X	Y	Z	R ¹	R ²
化合物 71	β -Cl	CH_2CH_2	$\text{CH}=\text{CH}$	シクロヘキシル	水素
化合物 72	β -Cl	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$	$\text{CH}=\text{CH}$	シクロヘキシル	水素

表 1 の つ づ き

	X	Y	Z	R ¹	R ²
化合物 45	β -Cl	CH_2CH_2	SCH_2	2,6-ジメチル-5-ヘプタニル	水素
化合物 46	β -Cl	o-インタフェニル	OCH_2	シクロヘキシル	水素
化合物 47	β -Cl	m-インタフェニル	OCH_2	シクロヘキシル	水素
化合物 48	β -Cl	p-インタフェニル	OCH_2	シクロヘキシル	水素
化合物 49	β -Cl	o-インタフェニル	SCH_2	シクロヘキシル	水素
化合物 50	β -Cl	m-インタフェニル	SCH_2	シクロヘキシル	水素
化合物 51	β -Cl	p-インタフェニル	SCH_2	シクロヘキシル	水素
化合物 52	β -Cl	CH_2CH_2	CH_2CH_2	シクロヘキシル	メチル
化合物 53	β -Cl	CH_2CH_2	CH_2CH_2	シクロヘキシル	水素
化合物 54	β -Cl	CH_2	CH_2CH_2	シクロヘキシル	水素
化合物 55	β -Cl	CH_2CH_2	CH_2CH_2	シクロヘキシル	水素
化合物 56	β -Cl	CH_2CH_2	CH_2CH_2	シクロヘキシル	水素
化合物 57	β -Cl	CH_2CH_2	CH_2CH_2	シクロヘキシルメチル	メチル
化合物 58	β -Cl	CH_2CH_2	CH_2CH_2	シクロヘキシルメチル	水素
化合物 59	β -Cl	CH_2CH_2	CH_2CH_2	シクロヘキシルメチル	メチル
化合物 60	β -Cl	CH_2CH_2	CH_2CH_2	シクロヘキシルメチル	水素
化合物 61	β -Cl	CH_2CH_2	CH_2CH_2	2-メチル-1-ヘキシル	メチル
化合物 62	β -Cl	CH_2CH_2	CH_2CH_2	2-メチル-1-ヘキシル	水素
化合物 63	β -Cl	CH_2CH_2	CH_2CH_2	2,6-ジメチル-5-ヘプタニル	メチル
化合物 64	β -Cl	CH_2CH_2	CH_2CH_2	2,6-ジメチル-5-ヘプタニル	水素
化合物 65	β -Cl	CH_2CH_2	CH_2CH_2	1-メチル-3-ヘキシル	メチル
化合物 66	β -Cl	CH_2CH_2	CH_2CH_2	1-メチル-3-ヘキシル	水素

WO 99/61029

PC

8

表 1 のつづき

	X	Y	Z	R ¹	R ²
化合物 45	β -Cl	CH_2CH_2	SCH_2	2,6-ジメチル-5-ヘプタジール	水素
化合物 46	β -Cl	o-インタフェイル	OCH_2	シクロヘキシル	水素

WO 99/61029

PC

7

表 1 のつづき

	X	Y	Z	R ¹	R ²
化合物19	β -Cl	CH ₂ CH ₂	OCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物20	β -Cl	CH ₂ CH ₂	OCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物21	β -Cl	CH ₂ CH ₂	OCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物22	β -Cl	CH ₂ CH ₂	OCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物23	β -Cl	CH ₂ CH ₂	OCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物24	β -Cl	CH ₂ CH ₂	OCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物25	α -Cl	CH ₂ CH ₂	OCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物26	β -Br	CH ₂ CH ₂	OCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物27	α -Br	CH ₂ CH ₂	OCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物28	F	CH ₂ CH ₂	OCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物29	β -Cl	CH ₂ CH ₂	SCH ₂	シクロヘキシル	tert-ブチル
化合物30	β -Cl	CH ₂ CH ₂	SCH ₂	シクロヘキシル	メチル
化合物31	β -Cl	CH ₂ CH ₂	SCH ₂	シクロヘキシル	メチル
化合物32	β -Cl	CH ₂ CH ₂	SCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物33	β -Cl	CH ₂ CH ₂	SCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物34	β -Cl	CH ₂ CH ₂	SCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物35	β -Cl	CH ₂ CH ₂	SCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物36	β -Cl	CH ₂ CH ₂	SCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物37	β -Cl	CH ₂ CH ₂	SCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物38	α -Cl	CH ₂ CH ₂	SCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物39	β -Br	CH ₂ CH ₂	SCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物40	α -Br	CH ₂ CH ₂	SCH ₂	シクロヘキシル	水素

WO 99/61029

PC

7

表 1 のつづき

	X	Y	Z	R ¹	R ²
化合物 19	β -Cl	CH_2CH_2	OCH_2	シクロヘキシル	水素
化合物 20	β -Cl	CH_2CH_2	OCH_2	シクロヘキシル	水素

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning
Operations and is not part of the Official Record**

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- ☐ BLACK BORDERS
- ☐ IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- ☒ FADED TEXT OR DRAWING
- ☒ BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING
- ☐ SKEWED/SLANTED IMAGES
- ☐ COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS
- ☐ GRAY SCALE DOCUMENTS
- ☐ LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT
- ☐ REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY
- ☐ OTHER: _____

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.